## (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



## . I LEBIS BEHADIR IN BEHAB HOM BOHN BOHN BAH IN HIN BOHN BEHAD HOM BOHN BIHN BIHN HOM BUBA HAN BUBA HAN BUBA H

(43) 国際公開日 2005 年2 月3 日 (03.02.2005)

**PCT** 

## (10) 国際公開番号 WO 2005/009992 A1

(51) 国際特許分類?: C07D 403/12, A61K 31/404, A61P 1/00, 3/10, 11/06, 17/06, 19/02, 25/00, 27/16, 29/00, 35/04, 37/02

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/010457

(22) 国際出願日:

2004年7月23日(23.07.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特願2003-201062 2003年7月

62 2003 年7 月24 日 (24.07.2003) JP

- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一 製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038234 東京都中央区日本橋 3 丁目 1 4番 1 0号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小野誠 (ONO, Makoto) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西1丁目16-13 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 野口滋 (NOGUCHI, Shigeru) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西1丁目16-13 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP).

- (74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町1丁目3番6号共同ビルTokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

## 添付公開書類:

一 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: CYCLOHEXANECARBOXYLIC ACID COMPOUND

(54) 発明の名称: シクロヘキサンカルボン酸類

(57) Abstract: A VLA-4 inhibitory drug which has high solubility in water and satisfactory long-term stability. It is sodium trans-4-[1-[2,5-dichloro-4-[(1-methyl1H-3-indolylcarbonyl)amino]phenylacetyl]-(4S)-methoxy-(2S)-pyrrolidinylmethoxy]cyclohexanecarboxylate pentahydrate.

(57) 要約: 水に対する溶解性が高く、また長期安定性が良好なVLA-4阻害薬を提供する。 トランス-4- [1- [2, 5-ジクロロ-4- [(1-メチル-1H-3-インドリルカルボニル) アミノ] フェニルアセチル] - (4S) - メトキシ- (2S) -ピロリジニルメトキシ] シクロヘキサンカルボン酸ナトリウム塩・5水和物。

